(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 14. Oktober 2004 (14.10.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 2004/087705 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 487/04, A01N 43/90

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/003102

(22) Internationales Anmeldedatum:

24. März 2004 (24.03.2004)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 103 14 760.8 31. März 2003 (31.03.2003)

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67065 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Karl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach (DE). BLETTNER, Carsten [DE/DE]; Richard-Wagner-Str. 48, 68165 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Stockingerstr. 7, 67227 Frankenthal (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestr. 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE]; Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhnhausen, 67157

Wachenheim (DE). GYPSER, Andreas [DE/DE]; B 4.4, 68159 Mannheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str. 24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr. 1, 67308 Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE]; Heinrich-Lanz-Str. 3, 68165 Mannheim (DE). SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Str.30, 76829 Landau (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Erlenstrasse 8, 68782 Brühl (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim (DE).

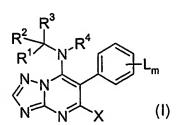
(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGE-SELLSCHAFT; 67065 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 7-ALKENYLAMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND USE THEREOF IN CONTROLLING HARMFUL FUNGI AND SUBSTANCES CONTAINING SAID TRIAZOLOPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: 7-ALKENYLAMINO-TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(57) Abstract: The invention relates to 7-alkenylamino-triazolopyrimidines of formula (I) wherein the substituents have the following meaning: L represents halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, amino, NHR or NR₂; R represents alkyl or alkyl-carbonyl; m represents 1, 2, 3, 4 or 5; X represents halogen, cyano, alkyl, halogenalkyl or alkoxy; R¹ represents alkyl or halogenalkyl; R² represents hydrogen, alkyl or halogenalkyl; R³ represents alkenyl which is unsubstituted or partially or totally halogenated or can be substituted according to the description; R⁴ represents hydrogen or alkyl, R³ and R⁴ can form, together with the nitrogen atom whereon they are bound, a five or six-membered unsaturated ring which can be interrupted by an atom from the groups O, N and S and/or can include one or several substituents.

The invention also relates to methods for producing said compounds, agents containing said compounds and the use thereof in controlling plant pathogenic harmful fungi.

(57) Zusammenfassung: 7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine der Formel (I) in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: L Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Amino, NHR oder NR₂; R Alkyl oder Alkyl carbonyl; m 1, 2, 3, 4 oder 5; X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl oder Alkoxy; R¹ Alkyl oder Halogenalkyl; R² Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl; R³ Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder gemäß der Beschreibung substituiert sein kann; R⁴ Wasserstoff oder Alkyl, R³ und R⁴ können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehre re Substituenten tragen kann; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.



WO 2004/087705 A1



(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen. 7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 7-alkenylamino-Triazolopyrimidine der Formel I

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 N
 N
 N
 N
 N
 N

in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- 10 L unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₀-Alkyl, C₁-C₀-Halogenalkyl, C₁-C₀-Alkoxy, Amino, NHR oder NR₂,
 - R C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl;
- 15 m 1, 2, 3, 4 oder 5;
 - X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
 - R¹ C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl;

20

- R² Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl;
- R³ C₂-C₁₀-Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^a tragen kann:

25

R³ Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Alkinyloxy oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl,

30

wobei diese aliphatischen oder alicyclischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

35

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino,

20

25

30

40

Formyi, Alkylcarbonyi, Alkylsulfonyi, Alkylsulfoxyi, Alkoxycarbonyi, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyi, Dialkylaminocarbonyi, Alkylaminothiocarbonyi, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyi- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₂-Alkyl,

10 R³ und R⁴ können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der einen oder mehrere Substituenten R³ tragen kann.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

Aus EP-A 71 792 und EP-A 550 113 sind 6-Phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. Die in den genannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Demgemäss wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften durch die Ausgestaltung der Alkenylgruppe in der 7-Position des Triazolopyrimidin-Gerüstes, die am α -C-Atom eine Verzweigung aufweist.

Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von Dihalogentriazolopyrimidinen der Formel II, in der Hal für ein Halogenatom, wie Brom oder, insbesondere Chlor, mit

Aminen der Formel III unter allgemein aus WO 98/46608 bekannten Bedingungen erhalten.

Die Umsetzung von II mit Aminen III wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol.

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganischen Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel III kann als Base dienen.

Amine der Formel III sind z.T. bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden, beispielsweise aus den entsprechenden Alkoholen über die Tosylate und Phthalimide [vgl. J. Am. Chem. Soc., Bd. 117, S. 7025 (1995); WO 93/20804], durch Reduktion der entsprechenden Nitrile [vgl. Heterocycles, Bd. 35, S. 2 (1993); Synthetic Commun. Bd. 25, S. 413 (1995); Tetrahedron Lett., S. 2933 (1995)], oder reduktive Aminierung von Ketonen [vgl. J. Am. Chem. Soc., Bd. 122, S. 9556 (2000); Org. Lett.
S. 731 (2001); J. Med. Chem., S. 1566 (1988)], aus den entsprechenden Halogeniden [vgl. Synthesis, S. 150 (1995)] und ggf. anschließender Alkylierung. Der Aufbau der Gruppe CR¹R² kann gegebenenfalls durch Grignard-Reaktion an entsprechenden Nitrilen oder Carbonsäureanhydriden erfolgen [vgl. J. Org. Chem., S. 5056 (1992)]. Amine der Formel III sind auch auf dem aus WO 02/088125 bekannten Weg zugänglich.

25

Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen, insbesondere Chlor, steht (Formel I.A), sind ein bevorzugter Gegenstand der Erfindung.

Verbindungen der Formel I, in der X Cyano oder C₁-C₆-Alkoxy bedeutet (Formel I.B), können vorteilhaft aus Verbindungen I, in der X Halogen [Hal], bevorzugt Chlor bedeutet, hergestellt werden, welche Formel I.A entsprechen.

10

25

30

Verbindungen I.A werden mit Verbindungen M-X' (Formel IV) zu Verbindungen I.B umgesetzt. Verbindungen IV stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid oder ein Alkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel IV hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.

Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

15 Verbindungen I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl steht (Formel I.C), können vorteilhaft ausgehend von Ausgangsstoffen der Formel I.A auf den nachfolgend skizzierten Routen hergestellt werden.

Verbindungen der Formel I.C, in denen X" C₁-C₄-Alkyl bedeutet, können durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I.A, mit metallorganischen Reagenzien der Formel V erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.

I.A
$$\frac{M^{y}(X'')_{y}}{V}$$

$$R^{1}$$

$$N$$

$$N$$

$$N$$

$$X''$$

$$I.C$$

In Formel V steht X" für C₁-C₄-Alkyl und M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, S.733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, S.358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. S.866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, S.8267 (1993); ebenda, Bd. 33, S.413 (1992).

Verbindungen der Formel I, in denen X für C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl steht (Formel I.C), können vorteilhaft auch durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:

Ausgehend von 5-Aminotriazol VI und dem Ketoester VII werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VIII erhalten. In Formel VII steht R für eine C₁-C₄-Alkylgruppe, insbesondere für Methyl oder Ethyl. Durch Verwendung der leicht zugängli-

20

chen 2-Phenylacetessigestern VIIa mit X"=CH₃ werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. 5-Aminotriazol VI ist kommerziell erhältlich. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen VII erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 bekannten Bedingungen.

Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VIII werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel IX umgesetzt.

Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid,
10 Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die
Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt
werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise
von 80 bis 125°C.

Die Umsetzung von IX mit Aminen III wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO 98/46608].

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganischen Basen, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel III kann als Base dienen.

Verbindungen der Formel I.C, können alternativ auch aus Verbindungen I.A und Malonaten der Formel XI hergestellt werden. In Formel XI bedeuten X" Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl und R C₁-C₄-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel XII umgesetzt und zu Verbindungen I.C decarboxyliert [vgl. US 5 994 360].

5 .

10

30

Die Malonate XI sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die anschließende Verseifung des Esters XII erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen XII vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I.C bereits ganz oder teilweise erfolgen.

XII $\frac{\Delta/H^+}{}$ I.C

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

WO 2004/087705 PCT/EP2004/003102

7

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säureoder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

15

20

25

30

35

40

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C_1 - C_6 -Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Me-

35

40

thyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-bu-10 tenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 15 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Alkenylen: ungesättigte, geradkettige Kohlenwasserstoffreste mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindungen in beliebiger Position.

Sofern R¹ und R² verschieden sind, stellt das die Gruppen R¹ bis R³ tragende C-Atom ein Chiralitätszentrum dar. In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)-und (S)-Isomere und die Razemate der Verbindungen der Formel I eingeschlossen.

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L_m, R¹, R², R³, R⁴ und X der Formel I.

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R¹ für Methyl oder Halogenmethyl, wie Trifluormethyl, steht.

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand sind Verbindungen I, in denen R² Wasserstoff ist.

Bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^3 für geradkettiges oder verzweigtes C_2 - C_{10} -Alkenyl steht, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei C_1 - C_3 -Alkoxygruppen tragen kann. Ein besonders bevorzugter Gegenstand sind Verbindungen I, in denen R^3 für geradkettiges oder verzweigtes C_2 - C_{10} -Alkenyl steht, welches unsubstituiert ist.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R³ und R⁴ gemeinsam eine C₃-C₄-Alkenylenkette bilden, die durch eine oder zwei Methyl- oder Halogenmethylgruppen substituiert sein kann.

5

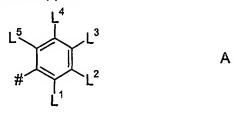
Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R⁴ Wasserstoff bedeutet.

Gleichermaßen bevorzugt-sind Verbindungen I, in denen R⁴ für Methyl oder Ethyl steht.

10 Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen mindestens eine Gruppe L orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst steht; insbesondere solche, in denen der Index m den Wert 1, 2 oder 3 aufweist.

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen L_m Fluor, Chlor, Methyl, C₁-Halogenalkyl, 15 Methoxy, Amino, NHR oder NR₂, worin R Methyl oder Acetyl ist, bedeutet.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen die durch Lm substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A



20

steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und

- L1 Fluor, Chior, CH3 oder CF3;

25

- L^3 Wasserstoff, Fluor, Chlor, CH₃, OCH₃, Amino, NHR oder NR₂; und
- L⁵ Wasserstoff, Chlor, Fluor oder CH3 bedeuten.

L²,L⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor:

- 30 Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen Lm für eine der folgenden Substituentenkombinationen steht: 2-Fluor-6-chlor, 2,6-Difluor, 2,6-Dichlor, 2-Fluor-6-methyl, 2,4,6-Trifluor, 2,6-Difluor-4-methoxy, Pentafluor, 2-Methyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl, 2-Methoxy-6-fluor, 2-Chlor, 2-Fluor, 2,4-Difluor, 2-Fluor-4-chlor, 2-Chlor-4-fluor, 2,3-Difluor, 2,5-Difluor, 2,3,4-Trifluor, 2-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Methyl-4-chlor, 2-Fluor-
- 35 4-methyl, 2,6-Dimethyl, 2,4,6-Trimethyl, 2,6-Difluor-4-methyl, 2-Trifluormethyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl-5-fluor oder 2-Trifluormethyl-5-chlor.

Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen X Halogen oder C₁-C₄-Alkyl, wie Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der
Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des
betreffenden Substituenten dar.

10

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-chlor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dichlor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-6-methyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trifluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methoxy und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m Pentafluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl-4-fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methoxy-6-fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Chlor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 12

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 13

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4-Difluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 14

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-4-chlor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Chlor-4-fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 16

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,3-Difluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,5-Difluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 18

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,3,4-Trifluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 19

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 20

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4-Dimethyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 21

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Methyl-4-chlor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 22

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Fluor-4-methyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 23

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Dimethyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 24

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,4,6-Trimethyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 .

Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2,6-Difluor-4-methyl und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-4-fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-fluor und R^2 Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R^1 , R^3 und R^4 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L_m 2-Trifluormethyl-5-chlor und R² Wasserstoff bedeuten und die Kombination von R¹, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle A

			•
Nr.	R ¹	R ³	. R⁴
A-1	CH ₃	CH=CH₂	Н
A-2	CH₃	CH=CH₂	CH₃
A-3	CH₃	CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-4	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	Н
A-5	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	. CH₃
A-6	CH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃

Nr.	R ¹	R ³	R⁴
A-7	CH₃	CH=CHCH₃	Н
A-8	CH₃	CH=CHCH₃	CH₃
A-9	CH₃	CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-10	CH₃	CH=CHCH₂CH₃	Н
A-11	CH₃	CH=CHCH₂CH₃	CH ₃
A-12	CH₃	CH=CHCH₂CH₃	CH₂CH₃
A-13	CH₃	CH=C(CH ₃) ₂	H ·
A-14	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH₃ ·
A-15	CH₃	CH=C(CH ₃) ₂	· CH₂CH₃
A-16	CH₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	Н .
A-17 ·	CH₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH₃
A-18	CH₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH₂CH₃
A-19	CH₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	H
A-20	CH ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH₃
A-21	CH₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃
A-22	CH₃	CH=CH(CH₂)₂CH₃	Н
A-23	CH₃	CH=CH(CH₂)₂CH₃	. CH₃
A-24	CH₃	CH=CH(CH₂)₂CH₃	CH₂CH₃
A-25	CH₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	Н
A-26	CH₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH₃
A-27	CH₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	. CH₂CH₃
A-28	CH₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Н
A-29	CH₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH₃
A-30	CH₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-31	CH₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	Н
A-32	CH₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH₃
A-33	CH₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-34	CH₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	Н
A-35	CH₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-36	CH₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴
A-37	CH₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	· H
A-38	CH₃ .	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-39	CH₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-40	CH₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	Н
A-41	CH₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH ₃
A-42	CH₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH₂CH₃
A-43	CH₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	Н
A-44	CH₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH₃
A-45	CH₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-46	CH₃	CH₂CH=CH₂	Н
A-47	CH₃	CH₂CH=CH₂	CH₃
A-48	CH₃	CH ₂ CH=CH ₂	. CH₂CH₃
A-49	CH₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	Н
A-50	CH₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH₃
A-51	CH₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃
A-52	CH₃	CH₂CH=CHCH₃	Н
A-53	CH₃	CH₂CH=CHCH₃	CH₃
A-54	CH₃	CH₂CH=CHCH₃	. CH₂CH₃
A-55	CH₃	CH(CH₃)CH=CH₂	Н
A-56	CH₃	CH(CH₃)CH=CH₂	CH ₃
A-57	CH₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-58	CH₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н
A-59	CH₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-60	CH₃	CH₂CH=C(CH₃)₂	CH₂CH₃
A-61	CH₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	, н
A-62	CH₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH₃
A-63	CH₃	CH₂C(CH₃)=CHCH₃	CH₂CH₃
A-64	CH₃	CH₂CH₂CH=CH₂	Н
A-65	CH₃	CH₂CH₂CH=CH₂	. CH₃
A-66	CH₃	CH₂CH₂CH=CH₂	CH₂CH₃

Nr.	R ¹	R ³	R⁴
A-67	CH ₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	Н
A-68	CH₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₃ .
A-69	CH₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃ .
A-70	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н
A-71	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-72	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-73	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Н
A-74	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH₃
A-75	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-76	. CH₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	Н
A-77	CH₃ ·	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₃
A-78	CH₃	CH₂CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-79	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н
A-80	CH₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-81	CH₃ .	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-82	CH₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	Н
A-83	CH₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH₃
A-84	CH₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-85	CH₃	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	#
A-86	CH₃ ·	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -	#
A-87	CH₃	-CH=CHCH₂CH(CH	l ₃)-#
A-88	CH₃	-CH=CHCH ₂ -#	
A-89	CH₃	-CH=CHCH(CH₃)	-#
A-90	CF ₃	CH=CH ₂	Н
A-91	CF ₃	CH=CH ₂	CH₃
A-92	CF ₃	CH=CH ₂	CH₂CH₃·
A-93	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	Н
A-94	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH₃
A-95	CF ₃	C(CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃
A-96	CF ₃	CH=CHCH₃	H·

Nr.	R ¹	R ³	R⁴
A-97	CF ₃	CH=CHCH₃	CH₃
A-98	CF₃	CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-99	CF₃	CH=CHCH₂CH₃	Н
A-100	∵ CF₃	CH=CHCH₂CH₃	CH₃
A-101	CF ₃	CH=CHCH₂CH₃	CH₂CH₃
A-102	CF₃	CH=C(CH₃)₂	Н
A-103	CF₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-104	CF₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-105	CF₃	C(CH ₃)=CHCH ₃	Н
A-106	CF₃	C(CH₃)=CHCH₃	CH₃
A-107	CF₃	C(CH₃)=CHCH₃	CH₂CH₃
A-108	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	Н
A-109	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH₃
A-110	CF₃ .	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃
A-111	CF₃	CH=CH(CH₂)₂CH₃	Н
A-112	CF ₃	CH=CH(CH₂)₂CH₃	CH₃
A-113	CF ₃	CH=CH(CH₂)₂CH₃	CH₂CH₃
A-114	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	Н
A-115	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH₃
A-116	CF ₃	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-117	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H .
A-118	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH₃
A-119	CF ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-120	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	Н
A-121	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH₃
A-122	CF ₃	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-123	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	Н
A-124.	CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-125	. CF ₃	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-126	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	Н

Nr.	R ¹	R ³	R ⁴
A-127	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH₃
A-128	CF ₃	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-129	CF₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	Н
A-130	CF ₃	C(CH ₂ CH ₃)=CHCH ₃	CH₃
A-131	CF ₃	C(CH₂CH₃)=CHCH₃	CH₂CH₃
A-132	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	Н
A-133	CF ₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH₃ .
A-134	CF₃	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-135	CF ₃	. CH ₂ CH=CH ₂	. Н
A-136	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH₃
A-137	CF₃·	CH₂CH=CH₂	CH₂CH₃
A-138	CF ₃	CH₂C(CH₃)=CH₂	Н
A-139	CF ₃	CH₂C(CH₃)=CH₂	CH₃
A-140	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃
A-141	CF ₃	CH₂CH=CHCH₃	Н
A-142	CF ₃	CH₂CH=CHCH₃	CH₃
A-143	CF ₃	CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-144	CF ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	Н
A-145	CF₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂	CH₃
A-146	CF₃	CH(CH₃)CH=CH₂	CH₂CH₃
A-147	CF₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н
A-148	CF ₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-149	CF₃	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-150	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	Н
A-151	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH₃
A-152	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CHCH ₃	CH₂CH₃
A-153	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Н
A-154	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH₃
A-155	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-156	CF ₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	Н

Nr.	R ¹	R ³	R⁴
A-157	CF₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₃
A-158	. CF₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-159	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н
A-160	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-161	CF₃	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-162	CF₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Н
A-163	CF₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH₃
A-164	CF₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-165	CF ₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	Н
A-166	CF ₃	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₃
A-167	CF ₃	CH₂CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-168	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н
A-169	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-170	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-171	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	Н
A-172	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH₃
A-173	CF ₃	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-174	CF ₃	-CH ₂ CH=CHCH ₂	#
A-175	CF ₃	-CH=CHCH ₂ CH ₂	#
A-176	CF ₃	-CH=CHCH₂CH(CF	l ₃)-#
A-177	CF ₃	-CH=CHCH₂-#	
A-178	CF ₃	-CH=CHCH(CH₃)	-#
A-179	CH₂F	CH=CH₂	Н
A-180	CH₂F	CH=CH₂	CH₃
A-181	CH₂F	. CH=CH ₂	CH₂CH₃
A-182	CH₂F	C(CH ₃)=CH ₂	Н
A-183	CH₂F	C(CH ₃)=CH ₂	CH₃
A-184	CH₂F	C(CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃
A-185	CH₂F	CH=CHCH₃	Н
A-186	CH₂F	CH=CHCH₃	CH₃

Nr.	R ¹	R ³	. R ⁴
A-187	CH₂F	CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-188	CH₂F	CH=CHCH₂CH₃	H ·
A-189	CH₂F	CH=CHCH₂CH₃	CH₃
A-190	CH₂F	CH=CHCH₂CH₃	CH₂CH₃
A-191	CH₂F	CH=C(CH ₃) ₂	Н
A-192	CH₂F	CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-193	CH₂F	CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-194	CH₂F	C(CH₃)=CHCH₃	Н
A-195	CH₂F	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH₃
A-196	CH₂F	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH₂CH₃
A-197	CH₂F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	Н
A-198	CH₂F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH₃
A-199	CH₂F	C(CH ₂ CH ₃)=CH ₂	CH₂CH₃
A-200	CH₂F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	Н
A-201	CH₂F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH₃
A-202	CH₂F	CH=CH(CH ₂) ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-203	CH₂F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	Н
A-204	CH₂F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH₃
A-205	CH₂F	CH=CHCH(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-206	CH₂F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Н
A-207	CH₂F	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH₃
A-208	CH₂F	CH=C(CH₃)CH₂CH₃	CH₂CH₃
A-209	CH₂F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	Н
A-210	CH₂F	C(CH ₃)=CHCH ₂ CH ₃	. CH₃
A-211	CH₂F	C(CH₃)=CHCH₂CH₃	CH₂CH₃
A-212	CH₂F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	Н
A-213	CH₂F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-214	CH₂F	C(CH ₃)=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-215	CH₂F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	Н
A-216	CH₂F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	·CH ₃

Nr.	R ¹	R ³	R⁴
A-217	CH₂F	C(=CH ₂)CH(CH ₃) ₂	CH₂CH₃
A-218	CH₂F	C(CH₂CH₃)=CHCH₃	Н
A-219	CH₂F	C(CH₂CH₃)=CHCH₃	CH₃
A-220	CH ₂ F	C(CH₂CH₃)=CHCH₃	CH₂CH₃
A-221	CH₂F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	Н
A-222	CH₂F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	· CH ₃
A-223	CH₂F	C(=CH ₂)CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH₂CH₃
A-224	CH₂F	CH₂CH=CH₂	H
A-225	CH₂F	CH₂CH=CH₂	CH₃
A-226	CH₂F	CH₂CH=CH₂	CH₂CH₃
A-227	CH₂F	CH₂C(CH₃)=CH₂	Н
A-228	CH₂F	CH₂C(CH₃)=CH₂	CH₃
A-229	CH₂F	CH₂C(CH₃)=CH₂	CH₂CH₃
A-230	CH₂F	CH₂CH=CHCH₃	Н
A-231	CH₂F	CH₂CH=CHCH₃	CH₃
A-232	CH₂F	CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃
A-233	CH₂F	CH(CH₃)CH=CH₂	Н
A-234	CH₂F	CH(CH₃)CH=CH₂	CH₃
A-235	CH₂F	CH(CH₃)CH=CH₂	CH₂CH₃
A-236	CH₂F	CH₂CH=C(CH₃)₂	Н
A-237	CH₂F	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃
A-238	CH₂F ·	CH₂CH=C(CH₃)₂	CH₂CH₃
A-239	CH₂F	CH₂C(CH₃)=CHCH₃	Н
A-240	, CH₂F	CH₂C(CH₃)=CHCH₃	CH₃
A-241	CH₂F	CH₂C(CH₃)=CHCH₃	CH₂CH₃
A-242	CH₂F	CH₂CH₂CH=CH₂	H
A-243	CH₂F	CH₂CH₂CH=CH₂	CH₃
A-244	CH₂F	. CH₂CH₂CH=CH₂	CH₂CH₃
A-245	CH₂F	CH₂CH₂CH=CHCH₃	Н
A-246	CH₂F	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₃

Nr.	R ¹	R ³	R⁴				
A-247	CH₂F	. CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃				
A-248	CH₂F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н				
A-249	CH₂F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃				
A-250	CH₂F	CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃				
A-251	CH₂F	CH₂CH₂CH₂CH=CH₂	Н				
A-252	CH₂F	CH₂CH₂CH₂CH=CH₂	CH₃				
A-253	CH₂F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH₂CH₃				
A-254	CH₂F	CH₂CH₂CH₂CH=CHCH₃	Н				
A-255	· CH ₂ F	CH2CH2CH2CH=CHCH3	CH₃				
A-256	CH₂F	CH₂CH₂CH=CHCH₃	CH₂CH₃				
A-257	CH₂F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	Н				
A-258	CH₂F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₃				
A-259	CH₂F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CH₂CH₃				
A-260	CH₂F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	Н				
A-261	CH₂F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH₃				
A-262	CH₂F	(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	CH₂CH₃				
A-263	CH₂F	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	#				
A-264	CH₂F	-CH=CHCH ₂ CH ₂ -#					
A-265	CH₂F	-CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)-#					
A-266	CH₂F	-CH=CHCH₂#					
A-267	CH ₂ F	-CH=CHCH(CH ₃)	-#				

kennzeichnet die Bindung zu dem Stickstoffatom

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Oomyceten und Basidiomyceten. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- Alternaria-Arten an Gemüse und Obst,
 - Bipolaris- und Drechslera-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
 - Blumeria graminis (echter Mehltau) an Getreide,
 - Botrytis cinerea (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
 - Erysiphe cichoracearum und Sphaerotheca fuliginea an Kürbisgewächsen,
- 10 Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen,
 - Mycosphaerella-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
 - Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
 - Plasmopara viticola an Reben,
 - Podosphaera leucotricha an Äpfeln,
- 15 Pseudocercosporella herpotrichoides an Weizen und Gerste,
 - · Pseudoperonospora-Arten an Hopfen und Gurken,
 - Puccinia-Arten an Getreide.
 - · Pyricularia oryzae an Reis,
 - Rhizoctonia-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 20 Septoria tritici und Stagonospora nodorum an Weizen,
 - Uncinula necator an Reben,
 - Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
 - Venturia-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.
- Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-cilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.
- Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.
- Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwi-35 schen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

WO 2004/087705 PCT/EP2004/003102

24

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Qubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B.Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

35

30

5

20

25

35

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

10 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

- 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen
 feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das
 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
 - II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- 111. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung
 40 gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8

WO 2004/087705

bis 10 Mol Ethylenoxid an 1Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calcium-salz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

5 IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

10

- V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-α-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).

20

25

30

15

VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Ver-

wendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermitttel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

20

5

10

15

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

25

30

35

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden,
Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der
Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide
mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden
Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph,
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,

- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocylische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxyfen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
 - Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl,
 - Phenylpyrrole wie Fenpicionil oder Fludioxonil,
 - Schwefel,
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid,
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl,
 Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
 - Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolylfluanid,
 - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

30 Synthesebeispiele

35

Die in dem nachstehenden Synthesebeispiel wiedergegebene Vorschrift wurde unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

15

20

25

30

35

40

Beispiel 1 - Herstellung von 5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(1-methyl-2-propen-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-1]

Eine Lösung von 1,5 mmol 5,7-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin [vgl. WO 98/46607] in 20 ml Dichlormethan wurde unter Rühren mit einer Lösung von 1,5 mmol (1-Methyl-2-propen-1-yl)amin [vgl. US 4 120 901; J. Chem. Soc., Chem. Commun., S. 794 (1984)] und 1,5 mmol Triethylamin in 10 ml Dichlormethan versetzt. Die Reaktionsmischung wurde etwa 16 Std. bei 20 – 25°C gerührt, dann mit verd. HCI-Lösung gewaschen. Nach Phasentrennung wurde die organische Phase getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 0,52 g der Titelverbindung vom Fp. 101°C.

Beispiel 2 - Herstellung von 5-Cyano-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(2,5-dimethylpyrrod-3-en-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

Eine Mischung von 0,1 mol der Verbindung I-10 und 0,25 mol Tetraethylammonium cyanid in 750 ml Dimethylformamid (DMF) wurde etwa 16 Std. bei 20-25°C gerührt. Nach Zusatz von Wasser und Methyl-tert.butylether (MTBE) und Phasentrennung wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen, dann getrocknet und von Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 4,32 g der Titelverbindung vom Fp. 206 °C.

Beispiel 3 - Herstellung von 5-Methoxy-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(2,5-dimethylpyrrod-3-en-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

Eine Lösung von 65 mmol der Verbindung I-10 in 400 ml wasserfr. Methanol wurde mit 71,5 mmol Natriummethanolat-Lösung (30%ig) bei 20-25°C versetzt. Nach etwa 16 Std. Rühren bei dieser Temperatur wurde das Lösungsmittel abdestilliert, der Rückstand wurde mit Dichlormethan aufgenommen. Die organische Phase wurde nach Waschen mit Wasser getrocknet, dann von Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 4,05 g der Titelverbindung vom Fp. 149 °C.

Beispiel 4 - Herstellung von 5-Methyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-(2,5-dimethylpyrrod-3-en-1-yl)-amino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

Eine Mischung von 20 ml Diethylmalonat und 0,27 g (5,65 mmol) Natriumhydrid (50% Dispersion in Mineralöl) in 50 ml Acetonitril wurde bei 20-25°C etwa 2 Std. gerührt. 4,7 mmol der Verbindung I-10 wurden zugesetzt, dann wurde die Mischung bei 60°C etwa 20 Std. gerührt. Nach Zusatz von 50 ml wässr. Ammoniumchlorid-Lösung wurde

mit verd. HCI-Lösung angesäuert, dann die Mischung mit MTBE extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden nach Trocknung vom Lösungsmittel befreit. Das durch Chromatographie an Kieselgel gereinigte Rohprodukt wurde mit konz. HCI. aufgenommen, die Mischung dann etwa 24 Std. bei 80°C gerührt. Nach Abkühlen wurde mit wässr. NaOH-Lösung ein pH-Wert von 5 eingestellt und die Reaktionsmischung mit MTBE extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden nach Trocknung vom Lösungsmittel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 0,62 g der Titelverbindung.

10 1 H-NMR (δ in ppm): 8,42 (s); 6,85 (m); 5,75 (s); 4,75 (q); 2,42 (s); 1,10 (s).

	ŢĪ	<u></u>	
,	ר, = קקל '=	= <u>/</u> _//	X
ر ج	X X	Z Z	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\

																	r
phys. Daten (Fp. [°C])	101	154	98	143	127	. 115	105	131	143	105	118	111	151	149	96	121	85
Ľ,	2,4,6-F ₃	2,4,6-F ₃	2,4,6-F ₃	2,4,6-F ₃	.2,4,6-F ₃	2-CH ₃ -4-F	2-CH ₃ -4-F	2-CI-6-F	2,6-F ₂	2,4,6-F ₃	2,4-F ₂	2,4-F ₂	2-CI	2-F	2-CH ₃ -4-F	2-CH ₃ -4-F	2-CH ₃ -4-F
×	ਠ	ਠ	ਹ	ਠ	ਹ	ਹ_	ਠ	ਠ	ರ	ਹ	ਹ	ਠ	ਹ	ರ	ਹ	ਹ	ਠ
₽ <u>0</u> 4	I	Ξ	I	H	H	Ŧ	I				I	I			I	I	I
R	CH=CH ₂	C(CH ₃)=CH ₂	CH=CHCH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	C(CH ₃)=CHCH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	C(CH ₃)=CHCH ₃	+CHC(CH3)#	-CH=CHC(CH ₃)-#	-CH=CHC(CH ₃)-#	CH=C(CH ₃) ₂	C(CH ₃)=CHCH ₃	-CH=CHC(CH ₃)-#	-CH=CHC(CH ₃)-#	CH=CH ₂	C(CH ₃)=CH ₂	CH=CHCH ₃
R ²	Ξ	F	I	I.	I	I	I	エ	Ŧ	I	I	I	I	I	I	I	I
.አ	ch3	ਮੁੰ	ਮੁੰ	Ę.	r HS	CH ³	cH ₃	ć H3	ਝੌ	ਲੌ	£ H	ਮੁੰ	ਮੁੰ	క్ర	ਤ ੰ	ਮੁੰ	ਝੌ
Ŗ.	1	1-2	F-1	14	-2	<u>9-</u>	2-1	8-1	6-1	1-10	1-11	1-12	1-13	1-14	1-15	1-16	1-17

phys. Daten (Fp. [°C])	105	126	72	92	72	. 80	72	86	132	158	91	119	.151	107	183	118	06	98
Lm	2,4,6-F ₃	2-CH ₃ -4-F	2,4-F ₂	2,4-F ₂	2,4-F ₂	2-CI-4-F	2-CI-4-F	2-CI-4-F	2-CI-4-F	2,4,6-F ₃	2,4,6-F ₃	2,4,6-F ₃	2,4,6-F ₃	2-CH ₃ -4-F	2-CH ₃ -4-F	2-CH ₃₋ 4-F	2,4-F ₂	2-CI-4-F
×	ರ	ರ	ರ	ಠ	ರ	ច	ਠ	ਠ	ਠ	ರ	ਠ	ਠ	ਹ	ਹ	ਹ	ਠ	ਠ	Ö
₽₩	I	I	エ	I	エ	I	I.	エ	Ξ	ъ Н	CH2CH3	Ξ.		I		I	エ	Н
R³	CH ₂ CH=CH ₂	CH2CH=CH2	CH=CH ₂	C(CH ₃)=CH ₂	CH=CHCH ₃	CH=CH ₂	C(CH ₃)=CH ₂	CH=CHCH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH=CH ₂	CH=CH ₂	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	+CH2CH=CHCH2#	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	-CH=CHC(CH ₃)-#	C(CH ₃)=CHCH ₃	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂
R ²	I	I	I	Ŧ	I	I	I	I	I	F	I	Ŧ	I	I	I	H	I	I
R.	ъ Н	£ HS	CH³	c H ₃	SH ₃	ਸੂ ਸੁ	cH ₃	г Н	£ H S	SH ₃	Н	· HS	ਸ਼ੂੰ ਮੁ	£	CH ₃	£ E	CH ₃	г у
Ŗ.	1-18	1-19	H-20	1-21	1-22	1-23	1-24	1-25	1-26	1-27	1-28	1-29	1-30	1-31	1-32	1-33	1-34	1-35

kennzeichnet die Bindung zu dem Stickstoffatom

Aufgrund der gehinderten Rotation der Phenylgruppe können zwei Diastereomeren existieren, die sich in ihren physikalischen Eigenschaften unterscheiden können.

WO 2004/087705 PCT/EP2004/003102

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

5

10

40

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani*

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropf-Nässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von Alternaria solani in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von 0,17 x 10⁶ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich der Blattbefall auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. I-1, I-5 und I-7 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

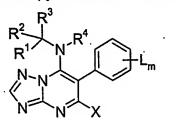
Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea*

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoff-konzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von Botrytis cinerea, die 1,7 x 10⁶ Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. I-1, I-5 und I-7 behandelten Pflanzen bis zu 3% Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 80 % befallen waren.

Patentansprüche

1. 7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine der Formel I



- 5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:
 - L unabhängig voneinander Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Amino, NHR oder NR₂,
- 10 R C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Alkylcarbonyl;
 - m 1, 2, 3, 4 oder 5;

15

25

30

35

- X Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
- R¹ C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl;
 - R² Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl;
- 20 R³ C₂-C₁₀-Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R³ tragen kann:
 - R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cyclo-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy oder C₃-C₆-Cycloalkyl,

wobei diese aliphatischen oder alicyclischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyl,

Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten:

R⁴ Wasserstoff oder C₁-C₂-Alkyl,

R³ und R⁴ können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie ge-10 bunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der einen oder mehrere Substituenten R³ tragen kann.

- 2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.
- Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der R¹ Methyl oder Halogenmethyl bedeutet.
- Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, in der R² Wasserstoff bedeutet.
 - 5. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für die Gruppe A

$$L^{5} \xrightarrow{L^{4}} L^{3}$$

$$L^{2}$$

25 steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Triazolopyrimidin-Gerüst ist und

- L¹ Fluor, Chlor, CH₃ oder CF₃;
- L²,L⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Fluor;
- 30 L³ Wasserstoff, Fluor, Chlor, CH₃, OCH₃, Amino, NHR oder NR₂; und
 - L⁵ Wasserstoff, Fluor oder CH₃ bedeuten.
- Werbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, in der die durch L_m substituierte Phenylgruppe für eine der folgenden Substituentenkombinatio-

nen steht: 2-Fluor-6-chlor, 2,6-Difluor, 2,6-Dichlor, 2-Fluor-6-methyl, 2,4,6-Trifluor, 2,6-Difluor-4-methoxy, Pentafluor, 2-Methyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl, 2-Methoxy-6-fluor, 2-Chlor, 2-Fluor, 2,4-Difluor, 2-Fluor-4-chlor, 2-Chlor, 2,3-Difluor, 2,5-Difluor, 2,3,4-Trifluor, 2-Methyl, 2,4-Dimethyl, 2-Methyl-4-chlor, 2-Fluor-4-methyl, 2,6-Dimethyl, 2,4,6-Trimethyl, 2,6-Difluor-4-methyl, 2-Trifluormethyl-4-fluor, 2-Trifluormethyl-5-fluor oder 2-Trifluormethyl-5-chlor.

7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 durch Umsetzung von Dihalogentriazolopyrimidinen der Formel II,

10

5

in der die Variablen die für Formel I gegebene Bedeutung haben und Hal für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor steht, mit Aminen der Formel III.

- 15 8. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.
- 9. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

Zusammenfassung

5

7-Alkenylamino-Triazolopyrimidine der Formel I

in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- 10 L Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Amino, NHR oder NR₂; R Alkyl oder Alkylcarbonyl; m 1, 2, 3, 4 oder 5;
 - X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl oder Alkoxy;
- 15 R¹ Alkyl oder Halogenalkyl;
 - R² Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl;
- R³ Alkenyl, welches unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein oder
 gemäß der Beschreibung substituiert sein kann;
 - R⁴ Wasserstoff oder Alkyl,
- R³ und R⁴ können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen fünf- oder sechsgliedrigen ungesättigten Ring bilden, der durch ein Atom aus der Gruppe O, N und S unterbrochen sein und/oder einen oder mehrere Substituenten tragen kann;
- Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Ver-30 wendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.



Internal Application No PCT/EP2004/003102

A. CLASSIF	ICATION OF SUBJECT	MATTER .
IPC 7	C07D487/04	A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Х	WO 02/02563 A (AMERICAN HOME PROD) 10 January 2002 (2002-01-10) abstract; example 52	1-6
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7 July 1993 (1993-07-07) Zeilen 45 und 47 in der Tabelle I abstract; claim 1	1–9
Y	US 6 284 762 B1 (PFRENGLE WALDEMAR) 4 September 2001 (2001-09-04) abstract; claim 1; examples 15,20,29,42 -/	1-9

Further documents are listed in the continuation of box C.	Patent family members are listed in annex.
Special categories of cited documents: 'A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance 'E* earlier document but published on or after the international filing date 'L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) 'O' document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means 'P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the International search	Date of mailing of the international search report
20 July 2004	29/07/2004
Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31–70) 340–3016	.Guspanova, J



Intentional Application No PCT/EP2004/003102

Citation of document, with Indication, where appropriate, of the relevant passages WO 02/083676 A (BASF AG; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMANN EBERHARD) 24 October 2002 (2002–10–24)	Relevant to claim No.
WO 02/083676 A (BASF AG; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMANN EBERHARD) 24 October 2002 (2002-10-24)	
(DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMANN EBERHARD) 24 October 2002 (2002-10-24)	1-9
Zeilen A-9 bis A-16 und A-33 bis A-40 in der Tabelle A Zeilen I-2 und I-10 bis I-15 in der Tabelle I abstract; claim 1	
WO 03/004465 A (GRAMMENOS WASSILIOS; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 16 January 2003 (2003-01-16) abstract; claim 1; table A	1-9
WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2 October 2003 (2003-10-02) page 5, lines 6-28; claims 1,6; tables 1-19 Zeilen A-77 bis A-79 in der Tabelle A abstract	1-9
	RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 16 January 2003 (2003-01-16) abstract; claim 1; table A WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2 October 2003 (2003-10-02) page 5, lines 6-28; claims 1,6; tables 1-19 Zeilen A-77 bis A-79 in der Tabelle A

INTERNATIONAL SEARCH REPORT Information on patent family members

Intentional Application No PC1/EP2004/003102

				FCI/EFZ	004/003102	
Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date	
WO 0,202563	A	10-01-2002	AU BG BR	7306201 A 107277 A 0112038 A	14-01-2002 30-01-2004 01-04-2003	
•			CA	2413802 A1	10-01-2002	
			CZ	20024150 A3	17-09-2003	
			EP	1307200 A2	07-05-2003	
			HU	0300798 A2	28-07-2003	
			JP	2004502691 T	29-01-2004	
			NO	20026195 A	27-02-2003 03-06-2003	
			SK WO	18412002 A3 0202563 A2	10-01-2002	
			US	2002068744 A1	06-06-2002	
EP 0550113		07-07-1993	EP	0550113 A2	07-07-1993	
			EP	0782997 A2	09-07-1997	
			GR	3033916 T3	30-11-2000 15-11-1997	
			AT AT	159256 T 192154 T	15-05-2000	
			AU	667204 B2	14-03-1996	
			AU	3043592 A	01-07-1993	
			BR	9205172 A	06-07-1993	
			CA	2086404 A1	01-07-1993	
			CN CN	1075144 A ,B 1141119 A ,B	11-08-1993 29-01-1997	
			DE	69222746 D1	20-11-1997	
			DE	69222746 T2	12-02-1998	
			DE	69230977 D1	31-05-2000	
			DE	69230977 T2	09-11-2000	
			DK DK	550113 T3 782997 T3	09-02-1998 07-08-2000	
			ES	2108727 T3	01-01-1998	
			ES	2147411 T3	01-09-2000	
			GR	3025920 T3	30-04-1998	
			HK	1010105 A1	23-06-2000 30-08-1993	
			HU IL	63305 A2 104244 A	13-07-1997	
			ĴΡ	3347170 B2	20-11-2002	
		• ,	JP	5271234 A	19-10-1993	
			NZ	245581 A	26-07-1995	
			PL PL	297160 A1 171579 B1	06-09-1993 30-05-1997	
•			PT PT	782997 T	29-09-2000	
			ŔŮ	2089552 C1	10-09-1997	
			SG	47563 A1	17-04-1998	
			US Za	5593996 A 9210043 A	14-01-1997 28-07-1993	
US 6284762	B1 .	04-09-2001	AT AT	239727 T 228133 T	15-05-2003 15-12-2002	
	•		AU	752669 B2	26-09-2002	
			AU	3098599 A	18-10-1999	
			AU	735730 B2	12-07-2001	
			AU	6867198 A	11-11-1998	
			BG	64197 B1 103805 A	30-04-2004 30-06-2000	
			BG		23-05-2000	
			RR	9808531 A	Z3~U3~ZUUU	
			BR BR	9808531 A 9909009 A	28-11-2000 28-11-1998	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT Information on patent family members

International Application No PCT/EP2004/003102

				101/212001/000102			
	tent document in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
IIS	6284762	B1		CA	2324154 /	41	30-09-1999
-				CN	1302299		04-07-2001
				CZ	20003472		16-01-2002
				CZ		B6	16-07-2003
				DE	69814375		12-06-2003
				DE	69814375		24-12-2003
				DE	69903988		02-01-2003
				DE		T2	27-03-2003
				DK	975635		02-06-2003
				DK	945453		16-12-2002
				EA	2906		31-10-2002
				EA	3281		24-04-2003
				EE	9900486		15-06-2000
				EP	0975635		02-02-2000
				ĒΡ	0945453		29-09-1999
				ĒΡ	1066291		10-01-2001
				ES	2188094		16-06-2003
				HÜ	0001993		28-10-2000
				HÜ	0101751		28-10-2001
				ΙL	132238		29-05-2003
				ĴΡ		A	24-11-1999
				JΡ		Ť	30-10-2001
				JP		Ť	22-07-2003
				NO	994973		13-10-1999
				NZ	500143		29-06-2001
				PL	343176		30-07-2001
			,	PT	945453	T	31-03-2003
				SI	975635		31-10-2003
				SK	141499		11-09-2001
				WO	9948893		30-09-1999
				ZA	200005867	A 	22-10-2001
WO	02083676	Α	24-10-2002	BR	0208756		11-05-2004
				CA	2443696		24-10-2002
				CZ	20032721		14-01-2004
				EE	200300499		15-12-2003
		•		MO	02083676		24-10-2002
				EP	1381609		21-01-2004
				SK	12522003		04-05-2004
y				US 	2004127509	A1 -	01-07-2004
WO	03004465	Α	16-01-2003	BR	0210858		29-06-2004
				CA	2452625		16-01-2003
				WO	03004465		16-01-2003
				EP	1406903	A2 	14-04-2004
	03080615	Α	02-10-2003	WO	03080615	A 4	02-10-2003

ionales Aktenzeichen PCT/EP2004/003102

A. KLASSIFTZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Petentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchlerter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) $IPK\ 7\ C070\ A01N$

Recherchlerte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchlerten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu

A (AMERICAN HOME PROD) DO2 (2002-01-10) ung; Beispiel 52 A (SHELL INT RESEARCH) (1993-07-07) d 47 in der Tabelle I ung; Anspruch 1	1-6
(1993-07-07) d 47 in der Tabelle I ung; Anspruch 1	1-9
B1 (PFRENGLE WALDEMAR) 2001 (2001-09-04) ung; Anspruch 1; Beispiele	1-9
	ung; Anspruch 1; Beispiele

 Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : 'A' Veröffentlichung, die den aligemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist 'E' älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist 'L' Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lessen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) 'O' Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht 'P' Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist 	 *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliogend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfarnifie ist
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
20. Juli 2004	29/07/2004
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Guspanova, J

Siehe Anhang Patentfamilie

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/003102

	Ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN	Potr Appeared No
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 02/083676 A (BASF AG; ALBERT GUIDO (DE); REHNIG ANNEROSE (DE); AMMERMANN EBERHARD) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) Zeilen A-9 bis A-16 und A-33 bis A-40 in der Tabelle A Zeilen I-2 und I-10 bis I-15 in der Tabelle I Zusammenfassung; Anspruch 1	1-9
Y	WO 03/004465 A (GRAMMENOS WASSILIOS; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 16. Januar 2003 (2003-01-16) Zusammenfassung; Anspruch 1; Tabelle A	1-9
P	WO 03/080615 A (GRAMMENOS WASSILIOS; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 2. Oktober 2003 (2003-10-02) Seite 5, Zeilen 6-28; Ansprüche 1,6; Tabellen 1-19 Zeilen A-77 bis A-79 in der Tabelle A Zusammenfassung	1-9

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PC17EP2004/003102

Im Recherchenbericht		Datum der		Mitglied(er) der	Datum der
ngeführtes Patentdokumer	nt	Veröffentlichung		Patentfamilie	Veröffentlichung
WO 0202563	Α	10-01-2002	AU	7306201 A	14-01-2002
			BG	107277 A	30-01-2004
			BR	0112038 A	01-04-2003
			CA	2413802 A1	10-01-2002
			CZ	20024150 A3	17-09-2003
			EP	1307200 A2	07-05-2003
			HU	0300798 A2	28-07-2003
			JP	2004502691 T	29-01-2004
			NO	20026195 A	27-02-2003
•			SK	18412002 A3	03-06-2003
			MO	0202563 A2	10-01-2002
			US	2002068744 A1	06-06-2002
EP 0550113	Α	07-07-1993	EP	0550113 A2	07-07-1993
			EP	0782997 A2	09-07-1997
			GR	3033916 T3	30-11-2000
•			ΑT	159256 T	15-11-1997
			AT	192154 T	15-05-2000
			AU	667204 B2	14-03-1996
			ΑU	3043592 A	01-07-1993
			BR	9205172 A	06-07-1993
			CA	2086404 A1	01-07-1993
			CN	1075144 A ,B	11-08-1993
			CN	1141119 A ,B	29-01-1997
			DE	69222746 D1	20-11-1997
•			DE	69222746 T2	12-02-1998
			DE	69230977 D1	31-05-2000
			DE	69230977 T2	09-11-2000
			DK	550113 T3	09-02-1998
			DK	782997 T3	07-08-2000
			ES	2108727 T3	01-01-1998
			ES GR	2147411 T3	01-09-2000
			HK	3025920 T3 1010105 A1	30-04-1998 23-06-2000
			HU	63305 A2	30-08-1993
			IL	104244 A	13-07-1997
·			JP	3347170 B2	20-11-2002
			JP	5271234 A	19-10-1993
			NZ	245581 A	26-07-1995
			PL	297160 A1	06-09-1993
		•	PL	171579 B1	30-05-1997
			ΡŢ	782997 T	29-09-2000
			RU	2089552 C1	10-09-1997
			SG	47563 A1	17-04-1998
			US	5593996 A	14-01-1997
			ZA	9210043 A	28-07-1993
US 6284762	B1	04-09-2001	AT	239727 T	15-05-2003
· · · ·			AT	228133 T	15-12-2002
			AU	752669 B2	26-09-2002
			AU	3098599 A	18-10-1999
			ΑU	735730 B2	12-07-2001
			AU	6867198 A	11-11-1998
			BG	64197 B1	30-04-2004
			BG	103805 A	30-06-2000
			BR	9808531 A	23-05-2000
			BR CA	9909009 A 2287470 A1	28-11-2000 22-10-1998

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Interponales Aktenzeichen
PC // EP2004/003102

Im Recherchenbericht ngeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
US 6284762	B1		CA	2324154		30-09-1999
			CN	•	T	04-07-2001
			CZ	20003472		16-01-2002
			CZ	292092		16-07-2003
			DE		D1	12-06-2003
			DE		T2	24-12-2003
			DE	69903988		02-01-2003
			DE	69903988		27-03-2003
			DK	975635		02-06-2003
			DK	945453		16-12-2002
			EΑ	2906	B1	31-10-2002
			EΑ	3281	B1	24-04-2003
			EE	9900486	Α	15-06-2000
			EP	0975635	A1	02-02-2000
			EP	0945453	A1	29-09-1999
			EΡ	1066291	A1	10-01-2001
			ES	2188094		16-06-2003
			HU	0001993	A2	28-10-2000
			HU	0101751	A2	28-10-2001
			ΙL	132238		29-05-2003
			JP	11322750		24-11-1999
			JP		T	30-10-2001
			JP	2003522100		22-07-2003
			NO	994973		13-10-1999
			NZ	500143		29-06-2001
			PL	343176		30-07-2001
			PT		T	31-03-2003
			SI	975635		31-10-2003
			SK	141499		11-09-2001
			WO	9948893		30-09-1999
•			ZA	200005867		22-10-2001
WO 02083676	Α	24-10-2002	BR	0208756	Α	11-05-2004
			CA	2443696		24-10-2002
			CZ	20032721		14-01-2004
			EE		Α	15-12-2003
			WO	02083676		24-10-2002
			ΕP	1381609		21-01-2004
			SK	12522003		04-05-2004
			US	2004127509		01-07-2004
WO 03004465	Α	16-01-2003	BR	0210858	A	29-06-2004
,,, ,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,	••	10 01 1000	CA	2452625		16-01-2003
			WO	03004465		16-01-2003
			EP	1406903		14-04-2004
WO 03080615	A	02-10-2003	 WO	03080615	A1	02-10-2003